



# UDRS

## Mi Universidad

*Moises Santiz Alvarez*

*Parcial I*

*Terapeutica farmacológica*

*Dr. Aldolfo Bryan Medellin Guillen*

*Medicina Humana*

*Cuarto Semestre Grupo A*

*Comitán de Domínguez, Chiapas a 3 de Marzo de 2025*

# AINES

Es una familia farmacológica destinada a la inhibición de una de las dos COX, enzimas involucradas en la cascada del ácido Araquidónico y tiene 4 propiedades (antiinflamatoria, antipirético, analgésicos y antiagregante plaquetario).

## Clasificación de los AINE según su selectividad cox.

- **Muy selectivos cox 1:** Ketorolaco y flurbiprofeno
- **Poco selectivos cox 1:** indometacina, ibuprofeno, ketoprofeno, AAS, naproxeno y paracetamol.
- **Muy selectivos cox 2:** ectoricoxib
- **Poco selectivos cox 2:** piroxicam, diclofenaco y celecoxib.

## Clasificación de los AINE según su estructura.

- **Derivados del ácido salicílico:** A. acetilsalicílico, etenzamida, salicilamina y diflunisal.
- **Derivados del ácido acético:** diclofenaco, indometacina, aceclofenaco y ketorolaco.
- **Derivados del ácido propiónico:** ibuprofeno, ketoprofeno, naproxeno, dexketoprofeno y dexibuprofeno.
- **Oxicam:** piroxicam, tenoxicam, meloxicam y lornoxicam.
- **Coxibs:** ectoricoxib, parecoxib y calecoxib.

**Mecanismo de acción:** va a actuar inhibiendo la cox lo que va reducir la producción de las prostaglandinas.

Cox1: está continuamente en los tejidos, principalmente en la mucosa gástrica y en los riñones, la ingesta frecuente de AINES que actúan sobre esta enzima, reduce la producción de PGE2 y PGI2, protectoras de la mucosa gástrica, lo que genera efectos adversos de estos fármacos en forma de úlceras gástrica

Cox2: actúa sólo durante los procesos de inflamación. Los Coxib que actúan sobre esta enzima tienen menos efectos adversos a nivel gástrico.

Cox3: produce diferentes polipéptidos sensibles a los fármacos analgésicos-antipiréticos, pero con bajo efecto antiinflamatorio, solo se encuentra en el paracetamol.

**ACIDO ACETILSALICILICO:** tiene efectos antiinflamatorio, analgésico, antipirético y antiagregante plaquetario. Inhibe la COX reduciendo la formación de PG, lo que impide la estimulación de receptores de dolor a nivel periférico y tiene efectos a nivel de hipotálamo.

**DERIVADOS DEL ACIDO PROPIÓNICO; IBUPROFENO, KETOPROFENO Y NAPROXENO:** Son inhibidores no selectivos de la COX y ejercen acción analgésica, antiinflamatoria y antipirética, pueden alterar la función plaquetaria alargar el tiempo de sangrado son “Inhibidores reversibles”.

**DERIVADOS DEL ACIDO ACETICO; INDOMETACINA:** tienen efecto antiinflamatorio, analgésico y antipirético, son de Inhibición reversible de la COX y tiene más tendencia a causar efectos adversos por lo que suele ser fármaco de reserva para situaciones agudas moderadas a graves.

**OXICAMS; PIROXICAM Y MELOXICAM:** el meloxicam inhibe a la COX-1 y 2, con más preferencia por COX-2. A dosis altas es una AINE no selectivo, tiene propiedades antiinflamatorio con potencia similar al naproxeno o la aspirina y el piroxicam tiene efecto analgésico, antipirético y antiinflamatorio.

**ACIDO ACÉTICOS; DICLOFENACO Y KETOROLACO:** El diclofenaco es más potente que la indometacina y naproxeno tiene efectos analgésicos, antiinflamatoria y antipirético y el ketorolaco tiene actividad analgésica potente, se usa a corto plazo en dolor moderado como postoperatorio hasta 5 días, “evitar su uso en pediatría y no superar dosis de 40 mg/día”.

**INHIBIDORES SELECTIVOS; CELECOXIB, ETORICOXIB Y PARECOXIB:** tienen efecto analgésico, antipirético y antiinflamatorio, pero no inhiben la agregación plaquetaria porque las plaquetas sólo tienen COX-1.

## INTERACCIONES

- La mayoría se excreta por vía renal y pueden aumentar las concentraciones séricas y toxicidad de litio.
- Pueden reducir en aclaramiento del metrotexato y aminoglucósidos.
- Interferir en efecto de fármacos antihipertensivos.
- Cuando se administra junto a diuréticos ahorradores de potasio, pueden causar retención de potasio y consecuente hiperpotasemia.
- Dosis elevadas de salicilato, se asocian a efecto hipoglucémico que puede alterar los efectos de antidiabéticos.

- La aspirina puede aumentar el efecto de la Warfarina y provocar hemorragias.

**Tabla V. Resumen de las interacciones más relevantes de los AINE.**

Tratamiento	AAS	Ibuprofeno	Piroxicam	Celecoxib	Diclofenaco	Paracetamol
Alcohol	+ Hemorragia	+ Hemorragia			+ Toxicidad	+ Hepatotoxicidad
Anticoagulantes orales (heparina, warfarina)	+ Hemorragia	+ Efecto Aco	+ Hemorragia	+ Hemorragia	+ Hemorragia	+ Aco a dosis > 2 g/día
Trombolíticos y AAG	+ Hemorragia	+ Hemorragia	+ Hemorragia			
Pentoxifilina		+ Hemorragia				
Ciclosporina, tacrolimus	+ Nefrotoxicidad	+ Nefrotoxicidad	+ Nefrotoxicidad	+ Nefrotoxicidad	+ Nefrotoxicidad	
Cimetidina, ranitidina	+ Toxicidad					
Corticoides (ex hidrocortisona)	+ Hemorragia	+ Hemorragia	+ Hemorragia		+ Efectos Gi	
Diuréticos	Fallo renal	Fallo renal				- Menos efecto
Tiazidas		+ Nefrotoxicidad	CBD	Oral	Phase III	
IECA, ARA II	+ Nefrotoxicidad	+ Nefrotoxicidad	+ Nefrotoxicidad	+ Nefrotoxicidad	+ Nefrotoxicidad	
ISRS	+ Hemorragia		+ Hemorragia	Reducir dosis ISRS	+ Hemorragia	
Antidiabéticos, insulina	+ Hipoglucemia	+ Hipoglucemia	+ Hipoglucemia			
Interferon	- Actividad IFN					
Betabloqueantes	- Efecto antiHTA	Fallo renal				
Antagonistas calcio (verapamilo)					- Eficacia diclof.	
Otros AINE salicilatos	+ Hemorragia	+ EA ibuprofeno		+ Úlceras GI		
Anticonvulsivantes (fenobarbital)						+ Hepatotoxicidad
Propranolol						+ Efecto paracetamol
Metoclopramida, domperidona						+ Abs. intestinal
Ibuprofeno	INHIBE efecto AAG					
Digoxina, fenitoína		+ IC	+ IC		+ dgx, + fenitoína	
Otros AINE		+ EA ibuprofeno			+ Efectos Gi	
Quinolonas		+ Convulsiones	+ Convulsiones		+ Convulsiones	
Vancomicina	+ Otoxicidad					
Rifampicina				- Concentración	- Diclofenaco	+ Aclaramiento Parac.
Voriconazol					+ Diclofenaco	
Ginkgo Biloba		+ Hemorragia				
Alimentos		- Velocidad Abs				
Colestiramina						- Abs paracetamol
Flucloxacilina						+ Acidosis metabólica
Metrotexato		+Toxicidad	+Toxicidad	+Toxicidad	Reducir dosis MTX	

### Medicamentos antiinflamatorios no esteroideos

Medicamentos antiinflamatorios no esteroideos	Dosis usual (oral)	Dosis diaria máxima recomendada
Medicamentos antiinflamatorios no esteroideos no selectivos		
Diclofenaco	75 mg 2 veces al día o 50 mg 3 veces al día 100 mg 1 vez al día de liberación lenta	150 mg
Etodolaco	300-500 mg 2 veces al día	1.200 mg
Fenoprofeno	300-600 mg 4 veces al día	3.200 mg
Flurbiprofeno	100 mg 2 o 3 veces al día	300 mg
Ibuprofeno	400-800 mg 4 veces al día	3.200 mg
Indometacina	25 mg 3 o 4 veces al día 75 mg 2 veces al día de liberación lenta	200 mg
Ketoprofeno	50-75 mg 4 veces al día 200 mg 1 vez al día de liberación lenta	300 mg
Meclofenamato	50 mg 3 o 4 veces al día	400 mg
Meloxicam*	7,5 mg 1 vez al día	15 mg
Nabumetona	1.000-2.000 mg/día en 1 dosis o en dosis divididas (500-1000 mg 2 veces al día)	2.000 mg
Naproxeno	250-500 mg 2 veces al día	1.500 mg
Oxaprozina	1.200 mg 1 vez al día	1.800 mg
Piroxicam	20 mg 1 vez al día	20 mg
Sulindaco	150-200 mg 2 veces al día	400 mg
Tolmetina	400 mg 3 veces al día	1.800 mg
Medicamentos antiinflamatorios no esteroideos selectivos de la ciclooxigenasa-2 (COX-2)		
Celecoxib	200 mg 1 o 2 veces al día	400 mg

\* La especificidad de COX-2 no está clara.

### Consideraciones

- El papel del paracetamol inhibe la COX-3 está todavía en estudio, aunque no tiene efecto, algunos autores consideran que es miembro de los AINES por este mecanismo de acción.
- El paracetamol a dosis >2 gr/día puede aumentar la actividad de los anticoagulantes orales.
- La sobredosis de aspirina se puede producir con dosis de >100 mg/kg/día durante más de dos días.
- La sobredosis de Ibuprofeno produce síntomas a dosis superiores a 80-100 mg/kg a las cuatro horas de la ingesta.
- La sobredosis de paracetamol se evalúa en 4 fases. La mínima dosis tóxica es de 6 gr/día en adultos y >100 mg/kg/día en niños. Dosis superiores a 20-25 gr son fatales

## Referencias

Art\_1059-ESP\_3.pdf